

AS: 88.337

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 0252756 00000006 Folios: 2
Fecha (AMB): 2004-03-16 17:13:51
Tramite : 011 PCI-PATENT 379 FASE NACI 538 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

REF: Expediente No. 02 052.756 - Solicitud de Patente FASE NACIONAL
Corresp. a la Solicitud Internacional PCT/CA01/00951
a favor de **DUCHESNAY INC.**
Titulada: **FORMULACIÓN DE ACCIÓN RÁPIDA**

RAMIRO CASTRO DUQUE, vecino de Bogotá, portador de la tarjeta Profesional No. 1003 del Consejo Superior de la Judicatura, obrando como apoderado de **DUCHESNAY INC.**, según lo acredita el documento de poder presentado en la Secretaría General, de acuerdo con el Artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, me permito solicitar que se examine si la invención contenida en la solicitud en referencia es patentable.

De acuerdo con lo anterior, me permito anexar el recibo oficial de caja No. 04-17,312 por valor de \$353.000.

Señor Superintendente,



RAMIRO CASTRO DUQUE
C.C. No. 170.322 de Bogotá
Código 340
T.P. No.1003 del C.S.J.
Cra 7 No. 16-56 Piso 9

Marzo 16, 2004
CHP/MEV/hsr.

195
195

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 82952756 00000006 Folios: 2
Fecha (AMD): 2004-03-16 17:13:51
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 PAGE MACI 530 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 17,312
FECHA : MARZO 2 DE 2004

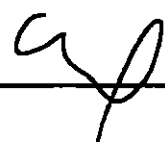
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
BRIGARD & CASTRO LTDA	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	12604932	02/03/2004	22,272,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	353,000.00
	TOTAL :	\$ 353,000.00

SON: TRESCIENTOS CINCUENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

DZ
196

(51) International Patent Classification ⁵ : A61K 9/24		A1	(11) International Publication Number: WO 94/06416 (43) International Publication Date: 31 March 1994 (31.03.94)
(21) International Application Number: PCT/EP93/02556 (22) International Filing Date: 21 September 1993 (21.09.93) (30) Priority data: MI92A002192 24 September 1992 (24.09.92) IT (71) Applicant (for all designated States except US): JAGOTEC AG [CH/CH]; Sonstrasse 47, CH-6052 Hergiswil (CH). (72) Inventors; and (73) Inventors/Applicants (for US only) : CONTE, Ubaldo [IT/IT]; Via Treviglio, 6, I-21052 Busto Arsizio (IT). LA MANNA, Aldo [IT/IT]; Via Lanfranco, 3, I-27100 Pavia (IT). MAGGI, Lauretta [IT/IT]; Via Polperti, 3, I-27100 Pavia (IT).		(74) Agent: GERVASI, Gemma; Notarbartolo & Gervasi, Viale Bianca Maria, 33, I-20122 Milano (IT). (81) Designated States: AU, CA, JP, NZ, US, European patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Published <i>With international search report.</i> <i>Before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of the receipt of amendments.</i>	
(54) Title: PHARMACEUTICAL TABLET CAPABLE OF LIBERATING ONE OR MORE DRUGS AT DIFFERENT RELEASE RATES			
(57) Abstract Pharmaceutical tablet consisting of a first layer containing one or more drugs with immediate or controlled release formulation, a second layer containing one or more drugs, either equal to or different from the first layer, with slow release formulation, and a low-permeability barrier-type layer coating said second layer or, alternatively, placed between the first and second layer and, if necessary, containing a drug.			

195
197

CLAIMS

- 1 1. Pharmaceutical compressed tablet capable of releasing one or
2 more drugs at different rates, consisting of three layers,
3 wherein
4 - a first layer contains one or more drugs with immediate or
5 controlled release formulation, composed of rapidly swelling
6 and/or soluble and/or erodible polymeric substances by contact
7 with aqueous fluids, and adjuvants;
8 - a second layer contains one or more drugs, either equal to or
9 different from those of the first layer, with slow release
10 formulation, composed of swelling and/or gelable and/or
11 erodible polymeric substances by contact with aqueous fluids,
12 and adjuvants;
13 - a low-permeability barrier-type layer coating said second
14 layer or, alternatively, placed between the first and second
15 layer, consisting of polymeric substances, adjuvants,
16 plasticizing agents and, if necessary, a drug.
- 1 2. The compressed tablet according to claim 1, wherein said
2 polymeric substances of said first layer are selected from the
3 group consisting of cross-linked polyvinylpyrrolidone, low- and
4 medium-molecular-weight hydroxypropyl cellulose and
5 hydroxypropyl methylcellulose, cross-linked sodium
6 carboxymethylcellulose, carboxymethyl starch, potassium
7 methacrylate-divinylbenzene copolymer, polyvinyl alcohols,
8 starches, starch derivatives, microcrystalline cellulose and

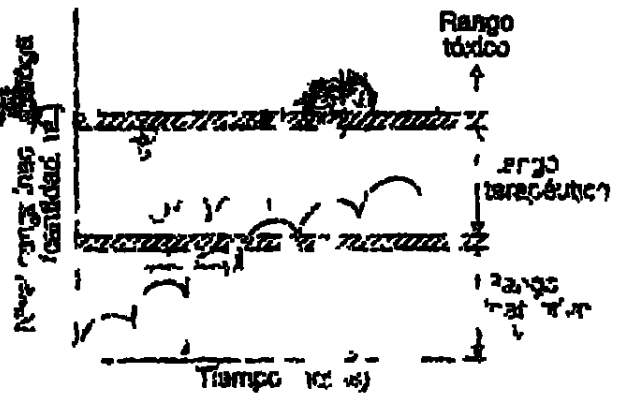
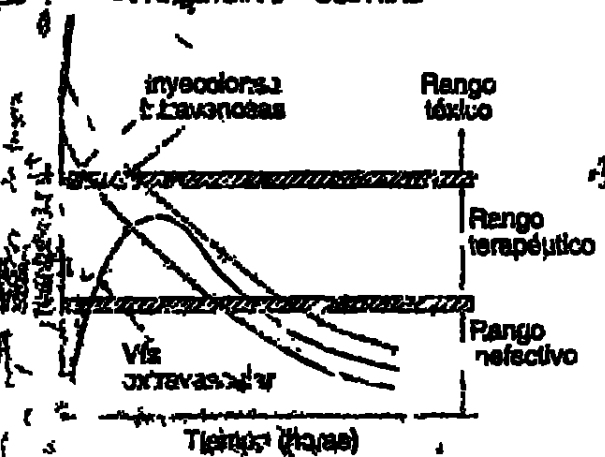
9 cellulose derivatives, β -cyclodextrin and dextrin derivatives.

1 3. The compressed tablet according to claim 1, wherein said
2 polymeric substances of said first layer equal 1.0 to 90% by
3 wt. of said layer.

1 4. The compressed tablet according to claim 1, wherein said
2 adjuvants of said first layer are selected from the group
3 consisting of starch, pregelled starch, calcium phosphate,
4 mannitol, lactose, saccharose, glucose, sorbitol,
5 microcrystalline cellulose, gelatin, polyvinylpyrrolidone,
6 methylcellulose, starch solution, ethylcellulose, arabic gum,
7 tragacanth gum, magnesium stearate, stearic acid, colloidal
8 silica, glyceryl monostearate, hydrogenated castor oil, waxes,
9 and mono-, bi-, and trisubstituted glycerides.

1 5. The compressed tablet according to claim 1, wherein said
2 polymeric substances of said second layer are selected from the
3 group consisting of hydroxypropyl methylcellulose having
4 molecular weight from 1,000 to 4,000,000, hydroxypropyl
5 cellulose having molecular weight from 2,000 to 2,000,000,
6 carboxyvinyl polymers, polyvinyl alcohols, glucans,
7 scleroglucans, mannans, xanthans, alginic acid and derivatives
8 thereof, carboxymethylcellulose and derivatives thereof,
9 poly(methyl vinyl ethers/maleic anhydride), ethylcellulose,
10 methylcellulose, and cellulose derivatives.

1 6. The compressed tablet according to claim 1, wherein said
2 polymeric substances of said second layer equal 5 to 90% by wt.
3 of said layer.



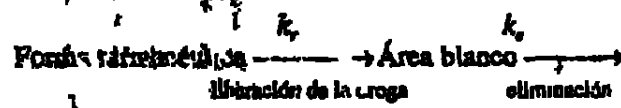
La dosis de la droga debe ser suficiente para producir el efecto deseado sin causar toxicidad.

El tipo de perfil de la concentración de la droga en función del tiempo depende del modo de administración por vía oral con dosis múltiples.

En muchos casos es necesario que la droga permanezca en el organismo durante un tiempo suficiente para producir el efecto deseado.

El perfil de absorción representa una curva de la droga en el sitio de absorción, y los términos k_a y k_e representan la velocidad de absorción y eliminación, respectivamente. La liberación de la droga de una forma farmacéutica depende de la velocidad de liberación k_r y de la velocidad de absorción k_a . Si $k_r \ll k_a$, la liberación es el factor limitante. Si $k_r \gg k_a$, la absorción es el factor limitante. Si $k_r \approx k_a$, ambos factores influyen.

En muchos casos es necesario que la droga permanezca en el organismo durante un tiempo suficiente para producir el efecto deseado. La liberación de la droga de una forma farmacéutica depende de la velocidad de liberación k_r y de la velocidad de absorción k_a . Si $k_r \ll k_a$, la liberación es el factor limitante. Si $k_r \gg k_a$, la absorción es el factor limitante. Si $k_r \approx k_a$, ambos factores influyen.



En esencia, la fase absorptiva del esquema clínico es una magnitud importante respecto de la fase de liberación. Así, el diseño por desarrollar un sistema de liberación no inmediata debe estar dirigido fundamentalmente a modificar la velocidad de liberación k_r y no la velocidad de absorción k_a .

La liberación de la droga de una forma farmacéutica depende de la velocidad de liberación k_r y de la velocidad de absorción k_a . Si $k_r \ll k_a$, la liberación es el factor limitante. Si $k_r \gg k_a$, la absorción es el factor limitante. Si $k_r \approx k_a$, ambos factores influyen.

- 1. Liberación de la droga.
- 2. Absorción de la droga.
- 3. Eliminación de la droga.

206
200

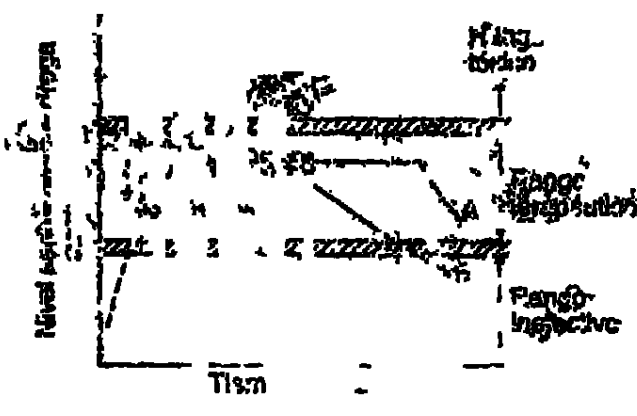


Fig. 94-2. Diagrama de ondas que muestra la liberación de drogas en un sistema de liberación controlada.

Fig. 94-3. Perfil de liberación de la droga en un sistema de liberación controlada.

Este tipo son los dispositivos y las células. El dispositivo es el que libera la droga y la célula es la que recibe la droga. La liberación de la droga es controlada por el dispositivo y la célula recibe la droga a lo largo del tiempo. Este tipo de dispositivos y células son los que se utilizan en los sistemas de liberación controlada.

Este tipo son los dispositivos y las células. El dispositivo es el que libera la droga y la célula es la que recibe la droga. La liberación de la droga es controlada por el dispositivo y la célula recibe la droga a lo largo del tiempo. Este tipo de dispositivos y células son los que se utilizan en los sistemas de liberación controlada.

Los sistemas de liberación controlada son los que permiten la liberación de la droga a lo largo del tiempo. Estos sistemas son los que se utilizan en los sistemas de liberación controlada.

Los sistemas de liberación controlada son los que permiten la liberación de la droga a lo largo del tiempo. Estos sistemas son los que se utilizan en los sistemas de liberación controlada.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

2020

Bogotá, D.C., Noviembre 1 de 2006

Abogado

RAMIRO CASTRO DUQUE**ASUNTO**

Radicación No.	02 052 756
Trámite	002
Evento	001
Actuación	430
Oficio No.	13208
Folios	0

Título de la solicitud: "FORMULACIÓN DE ACCIÓN RÁPIDA".

Como resultado del examen de patentabilidad de la solicitud de patente de invención, realizado según lo establece el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se notifica el siguiente concepto técnico:

Documentos estudiados

Para el presente estudio se tuvieron en cuenta el capítulo descriptivo comprendido en los folios 5 - 23 y el capítulo reivindicatorio de los folios 24 - 29 de la solicitud.

Objeto de la Invención

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:

Las reivindicaciones 1 - 13 y 16 se refieren a una formulación de acción rápida de piridoxina HCl y succinato de doxilamina recubierta entéricamente que comprende un agente desintegrante tal que se satisfagan los siguientes perfiles de disolución al medirlos en 1000 ml de tampón de fosfato a pH 6,8 y 37°C en un aparato de disolución tipo 2 a 100 rpm;

- a) por lo menos aproximadamente el 40% del total de la piridoxina HCl y del succinato de doxilamina se disuelven después de 30 minutos de medición;
- b) por lo menos aproximadamente el 70% del total de la piridoxina HCl y del succinato de doxilamina se disuelven después de 60 minutos de medición;
- c) por lo menos aproximadamente el 80% del total de la piridoxina HCl y del succinato de doxilamina se disuelven después de 90 minutos de medición;
- d) por lo menos aproximadamente el 90% del total de la piridoxina HCl y del succinato de doxilamina se disuelven después de 120 minutos de medición.

Preferentemente la formulación contendrá un núcleo recubierto con por lo menos un revestimiento entérico, comprendiendo el núcleo piridoxina HCl, succinato de doxilamina y los siguientes excipientes no activos: un relleno o ligante, un agente desintegrante, un lubricante, un acondicionador de flujo

silícico y un agente estabilizador, uso de compuestos (antagonistas del factor de liberación de corticotropina).

Las reivindicaciones 14 y 15 se refieren al uso de la formulación.

Las reivindicaciones 17 y 18, proceso para preparar la formulación.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de una composición para tratamiento de náusea y vómito, de liberación rápida y enmascarar sabor y olor.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una formulación de piridoxina HCl y succinato de doxilamina recubierta entéricamente.

El objeto de la invención definido anteriormente se clasificó de acuerdo con la IPC: A 61 K 9/00 // 33/12.

También se reivindica prioridad de la Solicitud de Patente WO2001CA00951 20010621; CA20002350195 20001220, con respecto a la cual la fecha de presentación de la actual solicitud cumple el plazo máximo permitido

Usos

El artículo 21 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: *"Los productos o procedimientos ya patentados, comprendidos en el estado de la técnica, de conformidad con el artículo 16 de la presente Decisión, no serán objeto de nueva patente, por el simple hecho de atribuirse un uso distinto al originalmente comprendido por la patente inicial".*

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que *"Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".*

El Artículo 19 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que *"Se considerará que una invención es susceptible de aplicación industrial, cuando su objeto pueda ser producido o utilizado en cualquier tipo de industria, entendiéndose por industria la referida a cualquier actividad productiva, incluidos los servicios."*

Las reivindicaciones 14 - 15 se refieren al uso de la formulación.

Se aclara que, de acuerdo con el Art 14, no se puede otorgar patente a usos porque estos no son un producto ni un procedimiento tecnológico.

De otro lado, de acuerdo con el Art 19, se considera que los usos no tienen aplicación industrial porque no se refiere a un tipo de producción ó utilización en ningún tipo de industria.

Además los usos de los reivindicados no pueden ser objeto de nueva patente, aunque el solicitante los considere distintos a los originalmente comprendidos por la patente inicial, porque estos se conocían originalmente en la.

Se aclara que los usos de la composición farmacéutica reivindicados no pueden ser objeto de nueva patente, aunque el solicitante los considere distintos a los originalmente comprendidos por la patente inicial, porque estos se conocían originalmente en la CA2139896 para tratamiento de náusea y vómito.

5. Con respecto a los Art. 28 y 30 de la D 486

El artículo 28 de la Decisión 486 establece: *"La descripción deberá divulgar la invención de manera suficientemente clara y completa para su comprensión y para que una persona capacitada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla."*

El artículo 30 de la Decisión 486 establece: *"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción."*

En cuanto a las reivindicaciones 1 - 13 y 16 se recuerda que el resultado a alcanzar no es una característica técnica de la invención. Las reivindicaciones deben definir la invención por sus características esenciales, en este caso por medio de los componentes de la formulación. La invención no queda definida por el resultado a alcanzar (tal como perfiles de disolución), puesto que la reivindicación incluiría no sólo la solución propuesta por el solicitante, sino todas las alternativas presentes o futuras que lleguen a ese resultado. Debe hacerse la corrección necesaria.

Determinación del Estado de la Técnica

El artículo 16 de la decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina que establece que *"El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida."*

Solo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica, el contenido de una solicitud de patente en trámite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el artículo 40".

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 20001220, se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

No.	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1(102)	CA 2138898	Use of Antinauseant Agent for Terminally Ill Humans	1998-07-11
D2 (198)	WO9408416	PHARMACEUTICAL TABLET CAPABLE OF LIBERATING ONE OR MORE DRUGS AT DIFFERENT RELEASE RATES	1994-03-31
D3 (198)	D3 Libro (*)	Remington Farmacia	1995

(*) GENNARO, Alfonso R. "Remington Farmacia". 19 ava. ed. Editorial Médica Panamericana pág 2471.

6. Evaluación de los requisitos de Patentabilidad

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que *"Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."*

En cumplimiento del artículo 14 de la Decisión 486, se procedió a evaluar el cumplimiento de los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial, con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

Las reivindicaciones 1 – 13 y 16 se refieren a una formulación de acción rápida de piridoxina HCl y succinato de doxilamina recubierta entéricamente que comprende un agente desintegrante tal que se satisfagan los siguientes perfiles de disolución al medirse en 1000 ml de tampón de fosfato a pH 6,8 y 37°C en un aparato de disolución tipo 2 a 100 rpm;

- a) por lo menos aproximadamente el 40% del total de la piridoxina HCl y del succinato de doxilamina se disuelven después de 30 minutos de medición;
- b) por lo menos aproximadamente el 70% del total de la piridoxina HCl y del succinato de doxilamina se disuelven después de 60 minutos de medición;
- c) por lo menos aproximadamente el 80% del total de la piridoxina HCl y del succinato de doxilamina se disuelven después de 90 minutos de medición;
- d) por lo menos aproximadamente el 90% del total de la piridoxina HCl y del succinato de doxilamina se disuelven después de 120 minutos de medición.

Preferentemente la formulación contendrá un núcleo recubierto con por lo menos un revestimiento entérico, comprendiendo el núcleo piridoxina HCl, succinato de doxilamina y los siguientes excipientes no activos: un relleno o ligante, un agente desintegrante, un lubricante, un acondicionador de flujo silícico y un agente estabilizador. uso de compuestos (antagonistas del factor de liberación de corticotropina).

Las reivindicaciones 17 y 18, proceso para preparar la formulación.

D1 enseña una formulación de piridoxina HCl y succinato de doxilamina

D2 enseña recubiertas entéricas de diversos polímeros, como p. ej. celulosa microcristalina.

D3 enseña los sistemas de liberación controlada de tipo espacial (liberación entérica).

Evaluación del Nivel Inventivo

El artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que *Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica.*

Se observa que:

- (a) debido a que los componentes de la formulación: piridoxina HCl, succinato de doxilamina y la recubierta entérica; eran conocidos en las anterioridades d1, D2, D3, una persona de habilidades ordinarias en el arte los adaptaría fácilmente a la preparación de la formulación reivindicada;
- (b) las reivindicaciones de esta solicitud no mencionan una característica que conceda un efecto diferente o especial a la formulación de piridoxina HCl y succinato de doxilamina recubierta entéricamente, que pueda considerarse como un aporte a la técnica, así que son obvios para una persona versada en la materia;
- (c) el problema planteado en esta solicitud que era la necesidad de una composición para tratamiento de náusea y vómito, de liberación rápida y enmascarar sabor y olor, se resuelve proporcionando una formulación de piridoxina HCl y succinato de doxilamina recubierta entéricamente, es decir de la misma manera como se resolvía en las anterioridades;
- (d) el resultado obtenido: es decir la formulación de piridoxina HCl y succinato de doxilamina recubierta entéricamente no es inesperado.
- (e) no parece haberse superado un prejuicio técnico anterior, con una formulación propuesta de piridoxina HCl y succinato de doxilamina recubierta entéricamente.

de manera que el objeto reivindicado no tiene nivel inventivo.

De la misma manera, el objeto del proceso reivindicado no tiene nivel inventivo porque los pasos mencionados: mezcla con los excipientes y posterior recubrimiento entérico, son obvios para cualquier persona de habilidades ordinarias en el arte.

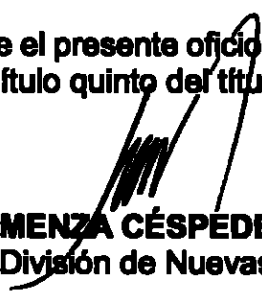
8. Conclusión

En conclusión, los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CA 2139896	1 – 13, 16, 17, 18	Nivel inventivo
D2	WO9408416	1 – 13, 16, 17, 18	Nivel inventivo
D3	D3 Libro (*)	1 – 13, 16, 17, 18	Nivel inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No. 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 11 / JUL 2006

CONCEPTO TÉCNICO No. 1737	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202007
------------------------------	-------------------------------------